

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平6-80564

(43)公開日 平成6年(1994)3月22日

(51)Int.Cl. ⁵	識別記号	府内整理番号	F I	技術表示箇所
A 61 K 31/195 7/00	A E D	9283-4C H 9164-4C C 9164-4C W 9164-4C		
31/375	A D A	9360-4C		

審査請求 未請求 請求項の数3(全3頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願平4-235535

(22)出願日 平成4年(1992)9月3日

特許法第30条第1項適用申請有り 1992年6月1日 株式会社世界文化社発行の「家庭画報6月号」に発表

(71)出願人 000006091

明治製菓株式会社

東京都中央区京橋2丁目4番16号

(72)発明者 竹村 司

埼玉県朝霞市大字浜崎1177番地の2

(54)【発明の名称】 抗色素沈着治療薬

(57)【要約】

【目的】本発明の目的は、より優れた肝斑(シミ)治療薬を開発することにある。

【構成】トラネキサム酸、ビタミンC、ビタミンB2群、ビタミンB6群もしくはそれらの塩類の医薬組成物は肝斑(シミ)治療に有効である。

【特許請求の範囲】

【請求項1】トラネキサム酸、ビタミンC及びビタミンB2群もしくはそれらの塩類を有効成分とする肝斑(シミ)治療用医薬組成物。

【請求項2】トラネキサム酸、ビタミンC及びビタミンB6群もしくはそれらの塩類を有効成分とする肝斑(シミ)治療用医薬組成物。

【請求項3】トラネキサム酸、ビタミンC、ビタミンB2群及びビタミンB6群もしくはそれらの塩類を有効成分とする肝斑(シミ)治療用医薬組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明は肝斑(シミ)の内用治療薬に関する。

【0002】

【従来の技術】肝斑、いわゆる30代以降の妊娠可能な女性にできはじめめるシミの治療法としてはビタミンC、トラネキサム酸やタチオノンの内用、ハイドロキノンやコウジ酸の外用が効果があるとされている(皮膚第30巻・第5号・昭和63年10月)。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】本発明者は、肝斑いわゆるシミが薄くなった患者を調べると、ビタミンCとトラネキサム酸と一緒に飲んでいることを以前からすでに発見していた。臨床データをとってみるとビタミンCとトラネキサム酸の併用は明らかに肝斑に効果が認められた。本発明者は肝斑に対し、さらに一層有効な治療薬を求めていた。

【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者はビタミンCとトラネキサム酸に加えビタミンB2群やビタミンB6群もしくはそれらの塩類を併用すると極めて効果が高いことをみつけた。具体的に示すと、ビタミンB2群もしくはその塩類としては、リボフラビン、リン酸リボフラビン、リン酸リボフラビンナトリウム、酪酸リボフラビン、フラビンアデニジヌクレオチド(FAD)、フラ*

基本処方

成分

トラネキサム酸

ビタミンC

ビタミンB2(FAD)

ビタミンB6(リン酸ピリドキサール)

1回量

500mg

200mg

10~15mg

20~30mg

1日量

1500mg

600mg

30~45mg

60~90mg

【0010】

症例	性	年齢	初診時症状	効果初発	判定時症状	投与期間	最終効果
1	女	41	G-4	2週	G-1	28週	著効
2	女	40	G-3	4週	G-0	16週	著効
3	女	39	G-3	6週	G-0	32週	著効
4	女	43	G-3	無	G-3	10週	無効
5	女	53	G-4	4週	G-2	16週	有効
6	女	39	G-4	6週	G-2	14週	有効

*ビンアデニジヌクレオチドナトリウムなどが上げられる。

【0005】ビタミンB6群もしくはその塩類としては、ピリドキシン、塩酸ピリドキシン、リン酸ピリドキシン、ピリドキサール、リン酸ピリドキサール、リン酸ピリドキサールカルシウム、塩酸ピリドキサール、ピリドキサミン、二塩酸ピリドキサミン、リン酸ピリドキサミンなどが上げられる。

【0006】使用量

10 遊離酸又は遊離塩基として成人1日量、トラネキサム酸: 200~2000mg、ビタミンC: 30~3000mg、ビタミンB2群: 1~100mg、ビタミンB6群: 1~100mgが使用され、その量を1回又は数回に分けて使用する。ビタミンB2群及びビタミンB6群は併用することが好ましいが、ビタミンB2群とビタミンB6群の少なくとも1群が使用されていれば本発明の目的は達成しうる。

【0007】剤型

剤型としては錠剤、カプセル、粒剤、液剤などの内服剤20として使用する。その場合、必要に応じて安定化剤、賦形剤、結合剤、崩壊剤などの医薬品添加物又は他の活性剤を含めることができる。その他の活性剤の1例として、パントテン酸又はその塩、パンテノール、ビオチン、ニコチニ酸、ニコチニ酸アミド、ビタミンE群などがあげられる。これらを上記有効成分とともに含めることにより、本発明の効果がより増す場合がある。

【0008】

【実施例】

実施例1

30 肝斑(シミ)の患者に対して、次の処方量1日3回に分けて投与した場合の結果を示す。比較例はビタミンB2群及びビタミンB6群を含めず処方したものである。又この処方により薬剤を投与した患者に副作用はまったく認められなかった。

【0009】

3							4
7	女	40	G-4	2週	G-1	20週	著効
8	女	46	G-4	2週	G-0	32週	著効
9	女	38	G-3	2週	G-0	30週	著効
10	女	40	G-4	4週	G-3	10週	やや有効
11	女	34	G-3	2週	G-1	10週	有効
12	女	39	G-4	2週	G-1	20週	著効
13	女	42	G-3	4週	G-0	24週	著効
14	女	41	G-3	2週	G-0	34週	やや有効
15	女	52	G-3	4週	G-1	18週	有効

【0011】比較例

10							
症例	性	年齢	初診時症状	効果初発	判定時症状	投与期間	最終効果
1	女	32	G-3	8週	G-1	32週	有効
2	女	45	G-4	2週	G-3	10週	やや有効
3	女	41	G-4	2週	G-1	52週	著効
4	女	37	G-3	6週	G-1	54週	有効
5	女	50	G-3	4週	G-2	10週	やや有効
6	女	44	G-3	4週	G-2	18週	やや有効
7	女	44	G-4	2週	G-3	48週	やや有効
8	女	31	G-3	4週	G-0	12週	著効
9	女	45	G-3	2週	G-0	14週	著効
10	女	41	G-4	無	G-4	12週	無効
11	女	52	G-4	無	G-4	28週	無効
12	女	37	G-4	4週	G-2	20週	有効
13	女	53	G-4	無	G-4	10週	無効
14	女	43	G-3	6週	G-1	32週	有効

【0012】肝斑の色素沈着度

G-4=厚化粧でも隠し得ない色素沈着

G-3=厚化粧では隠せるが、普通の化粧では隠し得ない色素沈着

G-2=普通の化粧では隠せるが、薄化粧では隠し得ない色素沈着

G-1=薄化粧では隠せるが、素肌では色素沈着を認め

る

G-0=素肌で色素沈着を認めない

【0013】効果判定基準

著効=色素沈着度が3段階以上軽快

有効=色素沈着度が2段階軽快

やや有効=色素沈着度が1段階軽快

無効=色素沈着度に変化を認めない

悪化=色素沈着度の増悪を認めた

【0014】効果

*上記基本処方による効果をまとめると次のようになる。

著効 - 8 / 15 件 (53.3%)

有効 - 4 / 15 件 (27.6%)

やや有効 2 / 15 件 (13.3%)

無効 - 1 / 15 件 (6.7%)

【0015】上記ビタミンB2及びビタミンB6未配合の場合の効果をまとめると次のようになる。

著効 - 3 / 14 件 (21.4%)

有効 - 4 / 14 件 (28.6%)

やや有効 4 / 14 件 (28.6%)

無効 - 3 / 14 件 (21.4%)

【0016】

【発明の効果】ビタミンCとトラネキサム酸に加えビタミンB2群及び/又はB6群を併用した場合は、併用しない場合に比べて肝斑(シミ)に対して治療効果が優れているので、本発明組成物は優れた医薬となった。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. 6

識別記号

府内整理番号

F I

技術表示箇所

A 61 K 31/44

9360-4 C

31/525

9360-4 C

// A 61 K 7/48

9051-4 C